

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 60-087224

(43)Date of publication of application : 16.05.1985

(51)Int.Cl.

A61K 35/78
// A61K 7/00

(21)Application number : 58-194732

(71)Applicant : POLA CHEM IND INC

(22)Date of filing : 18.10.1983

(72)Inventor : FUKUSHIMA MAKOTO
KITADA YOSHIO
NAKAMURA TADAO

(54) EMULSION-TYPE DERMATIC DRUG FOR EXTERNAL USE

(57)Abstract:

PURPOSE: To obtain the titled external drug, by extracting the crude drug such as TOKI (root of *Angelica acutiloba*), BYAKUSHI (root of *Angelica duhurica*) and SHIKON (root of *Lithospermum erythrorhizon*) with a specific organic solvent to obtain an oil phase containing viscous extract, esparately extracting the above crude durg with ethanol to obtain an aqueous phase containing powdery extract, and mixing and emulsifying the oily phase and the aqueous phase.

CONSTITUTION: One or more crude drugs selected from TOKI, BYAKUSHI and SHIKON are extracted with an organic solvent having low polarity (e.g. benzene, n- hexane, chloroform, etc.) and the obtained viscous extract is used as a component of an oily phase. Separately, the crude drugs are extracted with a 50W80% ethanol and the obtained powdery extract is used as a component of an aqueous phase. The oily phase is mixed and emulsified with the aqueous phase to obtain the objective emulsion- type dermatic drug for external use. The ethanol fraction extract of the above three kinds of crude drugs contains a component effective to keep the moisture of the skin and give the moistness to the skin.

EFFECT: Compared with the simple ethanol extraction of the crude drug, the use of the extraction residue with the organic solvent having low polarity is advantageous, and the extraction efficiency can be improved.

⑨ 日本国特許庁(JP)

⑩ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報(A)

昭60-87224

⑬ Int.Cl.⁴

識別記号

庁内整理番号

⑭ 公開 昭和60年(1985)5月16日

A 61 K 35/78
// A 61 K 7/00

7138-4C
7306-4C

審査請求 未請求 発明の数 1 (全4頁)

⑮ 発明の名称 乳化型皮膚外用剤

⑯ 特 願 昭58-194732

⑰ 出 願 昭58(1983)10月18日

⑱ 発 明 者 福 島 信 横浜市神奈川区高島台27番地1 ポーラ化成工業株式会社
横浜研究所内
⑱ 発 明 者 北 田 好 男 横浜市神奈川区高島台27番地1 ポーラ化成工業株式会社
横浜研究所内
⑱ 発 明 者 中 村 直 生 横浜市神奈川区高島台27番地1 ポーラ化成工業株式会社
横浜研究所内
⑲ 出 願 人 ポーラ化成工業株式会 静岡市弥生町648番地
社

明 細 書

1. 発明の名称 乳化型皮膚外用剤

2. 特許請求の範囲

- 1) 当帰、白芷、紫根より選択される1種または2種以上の生薬を極性の低い有機溶媒で抽出処理して得られた粘稠状エキスを含有する油相と、該生薬を50~80%エタノールで抽出処理して得られた粉末状抽出物を含有する水相とを、混合乳化してなる乳化型皮膚外用剤。
- 2) 極性の低い有機溶媒がベンゼン、n-ヘキサン、クロロホルム、エーテル等より選択される1種または2種以上の混合物である特許請求の範囲第1)項記載の乳化型皮膚外用剤。
- 3) 粉末状抽出物が生薬を極性の低い有機溶媒で抽出処理して得られた抽出残渣を50~80%エタノールで再抽出処理して得られたものである特許請求の範囲第1)項記載の乳化型皮膚外用剤。

3. 発明の詳細な説明

本発明は、皮膚外用剤における薬用効果を保持しつつ、皮膚への塗布性、吸収性を改善し、更には皮膚水分保持機能をも付与し得る新規な乳化型皮膚外用剤に関するものである。

古来より、当帰は強壯、鎮静、通経薬として白芷は鎮痛、止血、排膿、浄血薬として、また紫根は解毒、解熱薬として漢方の療法に広く利用されてきた。そしてこれらの使用にあつては煎剤等の用法をもつて熱水で抽出し、その抽出液を内服するという方法が通常であつた。但し、中国では白芷、当帰等を油脂で抽出し、軟膏として使用していた事例が幾つか見うけられ、一方日本においても紫根と当帰を油脂で抽出し軟膏として使用する紫雲膏と呼ばれるものがあつた。

しかしこれら公知の軟膏群は何れも油脂をもつて抽出する為、本発明者らの研究によつて抽出成分中には、抗菌性、抗炎症性を有する成分は存在するものの、余効、例えば皮膚水分保持作用、湿潤作用等を有する成分は全く存在しな

いことが突止められていた。

一方、前記漢方療法においても内服を中心とした適用であつた為、その成分の外用的（特に皮膚に対して）効能については、ほとんど研究すらされていないのが実情であつた。

そこで本発明者らは、この皮膚に対する前記3種の生薬の効能を詳細に調べたところ、抽出溶媒として50～80%エタノールを用いた分画抽出物中に、皮膚の水分を保持し、潤いを与える成分が存在することを見出した。更に、皮膚外用剤としての効能をより発揮させる為、前記3種の生薬を水と相溶性のほとんどない有機溶媒で抽出し、その成分を油相中に、また上記50～80%エタノール分画抽出物を水相中にそれぞれ含有させ、これらを混合乳化することにより優れた皮膚外用剤が得られることを知り本発明を完成させたものである。

本発明は当帰、白芷、紫根より選択される1種または2種以上の生薬を極性の低い有機溶媒で抽出処理して得られた粘糊状エキスを含有す

- 3 -

水分を保ち潤いを与える成分を含んだものが得られる。しかし、経済的（コスト的）観点から見た時には、生薬から単独に50～80%エタノール抽出するよりも、前記極性の低い有機溶媒による抽出した後の抽出残渣を用いることがより有利であり、また抽出効率をより高める為には次のような別法に従がうのがより実際的である。即ち、生薬を極性の低い有機溶媒で抽出処理し、口過後、残渣を水または熱水で十分に再抽出する。その後口過し、口液を操作上便利な程度まで濃縮する。次いでこれにアルコールを加え、そのアルコール濃度が50～80%になるように調整する。すると不溶物（このものには水分保持能がほとんどない）が沈殿してくるのでこれを口過し、口液を集め濃縮乾固すると上述と同じ成分を含有したものが得られる。

以上の様にして得られた抽出物の水分保持能を評価する為、本発明者らは人の足より剥離した角層を用い下記の1)、2)の方法によりその効果を検定した。その結果については表・1及

- 5 -

る油相と、該生薬を50～80%エタノールで抽出処理して得られた粉末状抽出物を含有する水相とを、混合乳化してなる乳化型皮膚外用剤に関するものである。

本発明において油相中に含有される粘糊状エキ스는次のような方法で調整される。すなわち先ず当帰、白芷、紫根の3種の生薬から目的に応じて任意に1種乃至は2種以上を選択し、これを水と相溶性のほとんどない例えばベンゼン、n-ヘキサン、クロロホルム、エーテル等の極性の低い有機溶媒の単独もしくは混合溶媒中で温浸抽出処理し、口過した口液を適宜な方法により濃縮乾固して得られる。これを通常の乳化の際油相として用いるエーテル類、エステル類、炭化水素類に溶解し、これを乳化物の油相として用いる。

また、水相中に含有される粉末状抽出物の調整法は以下の通りである。前記3種の生薬を50～80%エタノールで常温下または温浸下抽出処理し、口過した口液を濃縮すると皮膚の

- 4 -

び2に示す。

1) 抽出物を用いた測定

- ・試料：A. 水可溶、75%EtOH不溶部分（沈殿物）
- B. 水及び75%EtOH可溶部分
- C. 尿素（対照）
- D. 水（コントロール）

・方法：厚さ0.5mm、直径1cmの錠剤にプレスした角層を、上記A、B、Cの5%水溶液及びD中に30分間浸漬し、次いで余分な液をティッシュペーパーで軽く拭き取り、これを20℃、93%の一定温湿度下に放置し、5日後の角層100mg当りの水分残存（保持）量を測定した。n=5。

2) 抽出物を含有するクリームを用いた測定

- ・試料：a. n-ヘキサン抽出エキスを2wt%含有したクリーム
- b. 水可溶、75%EtOH不溶部分（沈殿物）を5wt%含有したク

- 6 -

リーム

c. 水及び75%EtOH可溶部分を5wt%含有したクリーム

d. a及びcの両成分を含有(7wt%)したクリーム(本発明品)

・方法: 1)の方法と同様に行なつた。n = 5。

表-1 水分保持量(抽出物)(n=5平均値)

試料	生薬名	水分保持量(%)
A	白 正	22.9
	当 帰	23.1
	紫 根	23.3
B	白 正	27.7
	当 帰	28.8
	紫 根	27.2
C		30.5
D		22.2

- 7 -

水分保持効果のいささかの減少も見られず、漢方軟膏が持つている予想される作用を加味し優れた皮膚外用剤を提供できるようになる。尚、念のため市販の紫雲膏と本発明のクリームdとの創傷治癒効果(治癒率、治癒日数)の比較検討をウサギを用いて測定したところ紫雲膏と同等乃至はそれ以上の効果が見られた。

本発明により得られる乳化型皮膚外用剤は、更に以下に挙げる如き利点及び特徴を有するものである。

- (1) 今までの漢方軟膏は硬く適量をとらずらく、皮膚の表面に均一に塗布しにくかつたが乳化することによりこの欠点は解消された。
- (2) 漢方の軟膏は油脂で高温で抽出することにより油脂の酸化が促進され皮膚に悪い作用を及ぼすPOV値の上昇が見られたが今回これが解消された。
- (3) 乳化することにより、薬効成分の吸収がよくなる生薬の使用量を軟膏の時より減らすことが出来るようになった。

- 9 -

表-2 水分保持量(クリーム)(n=5平均値)

試料	生薬名	水分保持量(%)
a	白 正	25.1
	当 帰	25.4
	紫 根	24.7
b	白 正	26.5
	当 帰	27.0
	紫 根	26.3
c	白 正	33.2
	当 帰	35.0
	紫 根	33.0
d	白 正	33.0
	当 帰	34.5
	紫 根	33.2
尿素(5%)入りクリーム		36.2
クリーム(ブランク)		24.3

表-1、2の結果が示すように、白正、当帰、紫根の水及び75%EtOH可溶抽出部分には明白な皮膚水分保持効果があることがわかる。また表-2のクリームd(本発明品)においても、

- 8 -

以下に本発明の実施例を示す。尚、処方中の配合割合はそれぞれ重量部である。

実施例1 クリーム

当帰100g、白正100gを混合し、ヘキサン1Lで2回温浸し、口過した口液を濃縮乾固しこれをエキス1とする。次に口過した残液を熱水1.5Lで2回抽出し、口過した口液を適当に濃縮し、アルコールを加えてその濃度が80%となるように調製する。次に煎取したもの口過し、口液を濃縮乾固し、エキス2とする。

これらエキス1、エキス2を次に示すクリーム処方中にそれぞれ配合し乳化する。

油	蜜ロウ	9.0
	流動パラフィン	20.0
	ラノリン	3.0
	半硬化植物油	25.0
	ソルビタンステアレート	5.0
相	ソルビタンステアレート-ポリオキエチレン-エーテル	2.0
	エキス1	2.0

- 10 -

水 相	水	28.0
	エキス2	5.0
	ホウ砂	0.7
	防腐剤	適量
	香料	適量

水 相	アルコール	8.5
	トラガントガム	2.0
	エキス2	3.0
	防腐剤	適量
	香料	適量

実施例2 乳液

当帰、白芷、紫根を70gずつ取り混合する。
混合物をエーテル1Lで2回温浸し、口過しロ
液を濃縮乾固し、エキス1とする。次に残渣を
熱水1.5Lで2回抽出し、ロ液を適当に濃縮し、
アルコールを加え、その濃度が70%となるよ
うに調製する。これを口過し、ロ液を濃縮乾固
し、エキス2とする。これらエキス1、及び2
を下に示す乳液処方中にそれぞれ配合し乳化す
る。

油 相	ステアリン酸	3.2
	エキス1	1.0
水 相	グリセリン	6.0
	アミノ酸	0.3
	水	75.5

- 11 -

特許出願人 ポーラ化成工業株式会社

- 12 -